Page 1 of 2

Российские патенты: Текст документа

### ФЕДЕРАЛЬНЫЙ ИНСТИТУТ ПРОМЫШЛЕННОЙ СОБСТВЕННОСТИ

|                          | COPCIBEH                              | НОСТИ                                 |
|--------------------------|---------------------------------------|---------------------------------------|
| Выбор баз<br>данных      |                                       | 1                                     |
| Допивіх                  | Yes 1                                 | 1 A. F. W                             |
| Параметры                | (11) Номер публикации                 | 000010                                |
| поиска                   |                                       | 2001124348                            |
|                          | (13) Вид документа                    | A                                     |
| Формулировка             | а (14) Дата публикации                | 2003.07.10                            |
| запроса                  | (19) Страна публикации                | · · · · · · · · · · · · · · · · · · · |
| Vac                      |                                       | RU                                    |
| Уточненный<br>запрос     | (21) Регистрационный номер заявки     | 2001124348/04                         |
|                          | (22) Дата подачи заявки               | 2000.01.31                            |
| Найденные                | (31) Номер конвенционной заявки       | 60/118,029                            |
| документы                | (32) Дата подачи конвенционной заяв   | Ки 1999.02.01                         |
|                          | (33) Страна приоритета                | บร                                    |
| Корзина                  | (31) Номер конвенционной заявки       | 60/124,316                            |
| Course                   | (32) Дата подачи конвенционной заяви  | /u 1000 03 43                         |
| Сохраненные запросы      | (33) Страна приоритета                | US                                    |
|                          | (31) Номер конвенционной заявки       | • .                                   |
| Статистика               | (32) Лата полашь компаний             | 60/133,374                            |
|                          | (32) Дата подачи конвенционной заявк  |                                       |
| Помощь                   | (33) Страна приоритета                | US                                    |
| 1                        | (31) Номер конвенционной заявки       | 60/135,573                            |
| Предложения              | (32) Дата подачи конвенционной заявк  | и 1999.05.24                          |
| 1                        | (33) Страна приоритета                | us                                    |
| Выход                    | (31) Номер конвенционной заявки       | 09/333,387                            |
|                          | (32) Дата подачи конвенционной заявкы | 4 1800 00 48                          |
|                          | (33) Страна приоритета                |                                       |
| У Вас осталось           |                                       | US                                    |
| 349 запросов<br>(0 у.е.) | (31) Номер конвенционной заявки       | 60/151,412                            |
| ( y.c.,                  | (32) Дата подачи конвенционной заявки | 1999.08.30                            |
|                          | (33) Страна приоритета                | US                                    |
|                          | (43) Дата публикации заявки           | 2003.07.10                            |
|                          | (546) Haven no week 1451/             |                                       |
|                          | (516) Номер редакции МПК              | 7                                     |
|                          | (51) Основной индекс МПК              | C07H19/00                             |
|                          | (51) Основной индекс МПК              |                                       |
|                          | (01) CONOBNON NAMERO WITH             | A61K31/70                             |
|                          | (51) Основной индекс МПК              | Sucus Service                         |
|                          | · ·                                   | A61P29/00                             |
|                          | Название                              | Композиция для борьбы с               |
|                          | /74\                                  | воспалительной реакцией               |
|                          | (71) Имя заявителя                    | ЮНИВЕРСИТИ ОФ ВИРДЖИНИЯ               |
|                          |                                       | ПЭЙТЕНТ ФАУНДЕЙШН (US)                |
|                          | (72) Имя изобретателя                 | السموطاناتات                          |
|                          | ( =                                   | ЛИНДЕН Джоэл М. (US)                  |
|                          | (72) Имя изобретателя                 | OARRIADAN S. S. D. MAD.               |
|                          | /72) Mars weeks                       | САЛЛИВАН Гейл В. (US)                 |
|                          | (72) Имя изобретателя                 | СЭРЕМБОК Ян Дж. (US)                  |
|                          | (72) Имя изобретателя                 |                                       |
|                          | •                                     | МАКДОНАЛЬД Тимоти (US)                |
|                          | (72) Имя изобретателя                 | ОКЬЮЗА Марк (US)                      |
|                          | (72) Имя изобретателя                 | Militaria                             |
| ,                        | ('L) ''IN NOUPEIAIENS                 | КРОН Ирвинг Л. (US)                   |
| (                        | (72) ИМЯ изобретателя                 |                                       |
|                          | • · · · ·                             | ШЕЛД В. Майкл (US)                    |
|                          |                                       |                                       |

FAX NO. : +99532334428

Aug. 12 2004 01:39PM P19

Российские патенты: Текст документа

Page 2 of 2

(74) Патентный поверенный

(85) Дата соответствия ст.22/39 РСТ

(86) Номер и дата международной или

региональной заявки

(87) Номер и дата международной или региональной публикации

(98) Адрес для переписки

Егорова Галина Борисовна

2001.09.03

US 00/02324 (31.01.2000)

WO 00/44763 (03.08.2000)

129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3, ООО "Юридическая фирма Городисский и Партнеры", пат.пов. Г.Б.

Егоровой



### ФЕДЕРАЛЬНЫЙ ИНСТИТУТ ПРОМЫШЛЕННОЙ СОБСТВЕННОСТИ



Выход

У Вас осталось 349 запросов №2001124348. Реферат

#### 1. Соединение формулы !

(X-Z-) n [C3 -C10 циклоалкил] - Z'-

$$V = C = C$$
 $V = C$ 
 $V = C$ 

где (а) каждый из R независимо представляет водород,  $C_1$ - $C_6$  алкил,  $C_3$ - $C_7$  циклоалкил, фенил или фенил ( $C_1$ - $C_3$ ) алкил;

со представляет -CH2OH, -CO2R4, -OC(0)R2, -CH2OC(0)R2 или С (О)NR3R4;

- (с) каждый из  $R^2$ ,  $R^3$  и  $R^4$  каждый независимо представляет H,  $C_{1-6}$ -алкил;  $C_{1-6}$ -алкил, замещенный одним-тремя  $C_{1-6}$ -алкокси,  $C_3$ - $C_7$  циклоалкилами,  $C_{1-6}$ -алкилтио, галогенами, гидрокси, амино, моно ( $C_{1-6}$ -алкил) амино, ди( $C_{1-6}$ -алкил) амино или  $C_{6-10}$  арилами, где арил может быть замещен одним-тремя галогенами,  $C_{1-6}$ -алкилами, гидрокси, амино, моно ( $C_{1-6}$ -алкил) амино или ди( $C_{1-6}$ -алкил) амино;  $C_{6-10}$ -арил; либо  $C_{6-10}$ -арил, замещенный одним-тремя галогенами, гидрокси, амино, моно ( $C_{1-6}$ -алкил) амино, ди( $C_{1-6}$ -алкил) амино или  $C_{1-6}$ -алкил) амино, ди( $C_{1-6}$ -алкил) амино или  $C_{1-6}$ -алкилами;
- (d) Z и Z' независимо представляют (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) алкил, необязательно прерванный одним-тремя S или непероксидным O, либо отсутствуют,

Page 2 of 7

а п равно 1-3,

или его фармацевтически приемлемая соль.

- 2. Соединение по п.1, в котором 5'-X представляет - $CH_2OH$  или -C(O)NR3R4.
- 3. Соединение по п.2, в котором 5'-X представляет C(O)NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>.
- 4. Соединение по п.3, в котором  $R^3$  представляет H, а  $R^4$ представляет ( $C_1$ - $C_4$ ) алкил.
- 5. Соединение по п.1, в котором каждый из R представляет Н или  $(C_1-C_4)$  алкил.
- 6. Соединение по п.1, в котором Z' представляет -CH<sub>2</sub>- или -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-
- 7. Соединение по п.6, в котором Z представляет - $CH_2$  или - $CH_2$ - $CH_2$ -.
- 8. Соединение по п.1, в котором  $C_3$ - $C_{10}$ циклоалкил представляет циклогексил или циклопентил.
- 9. Соединение по п.8, в котором X представляет ( $C_1$ - $C_4$ )алкоксикарбонил,  $C(O)NR^3R^4$  или ацетоксиметил.
- 10. Соединение по п.8, в котором X-Z представляет HO<sub>2</sub>C-Z.
- 11. Соединение по п.8, в котором X-Z и Z' представляют трансконфигурацию относительно С<sub>3</sub>-С<sub>10</sub> циклоалкила.
- 12. Соединение по п.1, в котором R представляет H, 5'-X представляет этиламинокарбонил, а (X-Z-) $\pi$ ((C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)циклоалкил)-Z'-С=С- представляет 2-(4-метоксикарбонилциклогексилметил)этинил или 2-(4-карбоксициклогексилметил)этинил.

Page 3 of 7

- 13. Соединение по п.1, в котором R представляет H, 5'-X представляет этиламинокарбонил, а (X-Z-)п[(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)циклоалкил] -Z'-C=C- представляет 2-(4-ацетоксиметилциклогексилметил) этинил.
- 14. Соединение по п.1, представляющее собой [4-(3-{9-(2R, 3R, 4S, 5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6-аминопурин-2-ил]проп-2-инил)циклогексил] метилацетат или его фармацевтически приемлемую соль.
- 15. Соединение по п.1, представляющее собой [(2R,3R,4S,5S)-5-(6-амино-2-{3-[4-(оксиметил)циклогексил]-проп-1-инил}пурин-9-ил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-N-этилкарбоксамид или его фармацевтически приемлемую соль.
- 16. Соединение по п.1, представляющее собой метил 4-(3-{9-[(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6аминопурин-2-ил)}проп-1-инил)цикло-гексанкарбоксилат или его фармацевтически приемлемую соль.
- 17. Соединение по п.1, представляющее собой 4-(3-{9[(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6аминопурин-2-ил)}проп-1-инил)циклогексан-карбоновая кислота или
  его фармацевтически приемлемую соль.
- 18. Соединение по пп.1-17 для применения в лечении.
- 19. Соединение по п.18, в котором лечение представляет собой подавление воспалительной реакции.
- 20. Соединение по n.18, в котором 5'-Х представляет  $CH_2OH$  или C  $(O)NR^3R^4$ .
- 21. Соединение по п.18, в котором 5'-Х представляет  $C(O)NR^3R^4$ .

# SUITE DE PAGE 002 43. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана ударом, травматическим повреждением головного или спинного

.../fips.dll?key=FLRZXOJFVQRN&ty=8&docnm=1&doc=2001124348&cl=2&rm=78694 12.08.04

Page 5 of 7

- 33. Соединение по п.18, представляющее собой [(2R,3R,4S,5S)-5-(6-амино-2-{3-[4-гидроксиметил)циклогексил]проп-1-инил}пурин-9-ил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-N-этил-карбоксамид.
- 34. Соединение по п.18, представляющее собой метил 4-(3-{9-[(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6аминопурин-2-ил)}проп-1-инил)циклогексанкарбоксилат.
- 35. Соединение по п.18, представляющее собой 4-(3-{9-[(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6аминопурин-2-ил)}проп-1-инил)циклогексанкарбоновую кислоту.
- 36. Соединение по п.18, в котором лечение дополнительно включает применение ингибитора фосфодизстеразы, тип IV.
- 37. Соединение по п.36, в котором ингибитором является ролипрам.
- 38. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана ишемией.
- 39. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция связана атеросклерозом.
- 40. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана аутоиммунным заболеванием.
- 41. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана ишемическим/реперфузионным повреждением.
- 42. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция возникает в сердце, почке или легком.
- 43. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана

- 22. Соединение по п.21, в котором  $R^3$  представляет H, а  $R^4$  представляет ( $C_1$ - $C_4$ ) алкил.
- 23. Соединение по п.18, в котором каждый из R представляет H или  $(C_1-C_4)$  алкил.
- 24. Соединение по п.18, в котором Z' представляет - $\mathrm{CH}_2$ -или - $\mathrm{CH}_2$   $\mathrm{CH}_2$ -.
- 25. Соединение по л.18, в котором Z представляет - $\mathrm{CH_2}$ -или - $\mathrm{CH_2}$ -
- 26. Соединение по п.18, в котором  $C_3$ - $C_{10}$  циклоалкил включает циклогексил или циклопентил.
- 27. Соединение по п.26, в котором X представляет ( $C_1$ - $C_4$ ) алкоксикарбонил или ацетоксиметил.
- 28. Соединение по п.26, в котором X-Z представляет  $HO_2$ C-Z-.
- 29. Соединение по п.26, в котором X-Z и Z' представляют трансконфигурацию относительно  $C_3$ - $C_{10}$  циклоалкила.
- 30. Соединение по п.18, в котором R представляет H, X представляет этиламинокарбонил, а (X-Z-)n[(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил]-Z'-C=C-представляет 2-(4-метоксикарбонилциклогексилметил)этинил или 2-(4-карбоксициклогексилметил)этинил.
- 31. Соединение по п.18, в котором R представляет H, X представляет этиламинокарбонил, а  $(X-Z-)n[(C_3-C_{10})-$ циклоалкил $]-Z'-C_{\equiv}C-$  представляет 2-(4-ацетоксиметилциклогексилметил) этинил.
- 32. Соединение по п.18, представляющее собой [4-(3-{9-(2R,3R,4S,5S)-5-(N-этилкарбамоил)-3,4-дигидроксиоксолан-2-ил]-6-аминопурин-2-ил}проп-1-инил)циклогексил]метилацетат.

Page 6 of 7

мозга.

- 44. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана пересадкой органа, ткани или клетки.
- 45. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана инфекцией.
- 46. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция связана с заболеванием кожи.
- 47. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана ангиопластикой, введением стента, шунта или имплантацией.
- 48. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана аллергическим заболеванием.
- 49. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана изнуряющей болезнью.
- 50. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана иммуноподавляющей терапией.
- 51. Соединение по п.19, в котором воспалительная реакция вызвана патологическим состоянием или симптомом у млекопитающего, причиной которого является активность А<sub>2A</sub>-рецепторов аденозина, и желателен агонизм такой активности.
- 52. Применение соединения по пп.1-17 в качестве лекарственного препарата для лечения воспаления.
- 53. Применение по п.52, в котором лекарственный препарат включает ингибитор фосфодиэстеразы, тип IV.
- 54. Применение по п.53, в котором ингибитором фосфодиастеразы

FROM : GUARAMADZE PATENT BUREAU.

FAX NO. : +99532334428

Aug. 12 2004 01:42PM P25

Российские патенты: Текст документа

Page 7 of 7

является ролипрам.

55. Применение по п.53, в котором лекарственный препарат включает жидкий носитель.

56. Применение по п.53, в котором лекарственный препарат адаптирован для парентерального введения.

FROM: GVARAMADZE PATENT BUREAU FAX

FAX NO. : +99532334428

Aug. 12 2004 01:42PM P26 Page 15 of 15

Российские патенты: Текст документа

где W представляет собой атом водорода, низшую алкильную группу, атом галогена, низшую алкоксигруппу, моно- или ди-низшую алкиламиногруппу, или замещенную или незамещенную фенильную группу, Y<sup>2</sup> представляет собой атом водорода, низшую алкильную группу, циклоалкильную группу, циклоалкил-низшую группу, низшую алкенильную группу или замещенную или незамещенную фенилнизшую алкильную группу, и А представляет собой замещенную или незамещенную фенильную группу, или замещенную или незамещенную тетероарильную группу.



## This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

### **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

BLACK BORDERS

IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES

FADED TEXT OR DRAWING

BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING

SKEWED/SLANTED IMAGES

COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

| Ц | LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT                   |
|---|-------------------------------------------------------|
|   | REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY |

### IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

☐ GRAY SCALE DOCUMENTS

OTHER:

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.